

PATENT COOPERATION TREATY

WO 2005/047276
PCT/EP2004/01265

From the INTERNATIONAL BUREAU

(K)

PCT

NOTIFICATION CONCERNING
TRANSMITTAL OF COPY OF INTERNATIONAL
APPLICATION AS PUBLISHED OR REPUBLISHED

To:

BEST, Michael
Lederer & Keller
Prinzregentenstr. 16
80538 München
ALLEMAGNE

Date of mailing (day/month/year)
06 October 2005 (06.10.2005)

Applicant's or agent's file reference
103 52 659.5

IMPORTANT NOTICE

International application No.
PCT/EP2004/012659

International filing date (day/month/year)
09 November 2004 (09.11.2004)

Priority date (day/month/year)
11 November 2003 (11.11.2003)

Applicant

RATIOPHARM GMBH et al

The International Bureau transmits herewith the following documents:



copy of the international application as published by the International Bureau on under
No. WO



copy of international application as republished by the International Bureau on 06 October 2005 (06.10.2005) under
No. WO 2005/047276

For an explanation as to the reason for this republication of the international application, reference is made to INID codes (15), (48)
or (88) (as the case may be) on the front page of the attached document.

LEDERER & KELLER
EINGANG / RECEIPT
13.10.2005
Erl:

The International Bureau of WIPO
34, chemin des Colombettes
1211 Geneva 20, Switzerland

Authorized officer

Agnes Wittmann-Regis

File No. +41 22 740 14 35

Facsimile No. +41 22 338 89 70

ST/IB/311 (January 2004)

BEST AVAILABLE COPY

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum
26. Mai 2005 (26.05.2005)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer
WO 2005/047276 A3

(51) Internationale Patentklassifikation⁷: C07D 309/30

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP2004/012659

(22) Internationales Anmeldedatum:
9. November 2004 (09.11.2004)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:
103 52 659.5 11. November 2003 (11.11.2003) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von
US): RATIOPHARM GMBH [DE/DE]; Graf-Arco-Str.
3, 89079 Ulm (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): TARAROV, Vitali
[RU/RU]; Chertanovskaya Str. 51-3-275, Moskau (RU).
KÖNIG, Gerd [DE/DE]; Am Fuchsgraben 11 E. 08056
Zwickau (DE). BÖRNER, Armin [DE/DE]; Im Winkel
40, 18059 Rostock (DE).

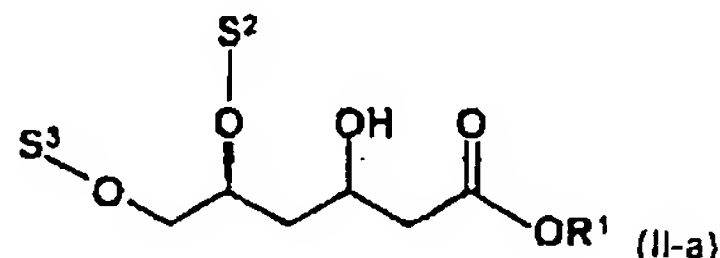
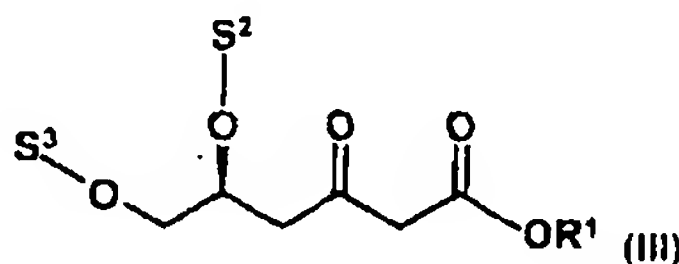
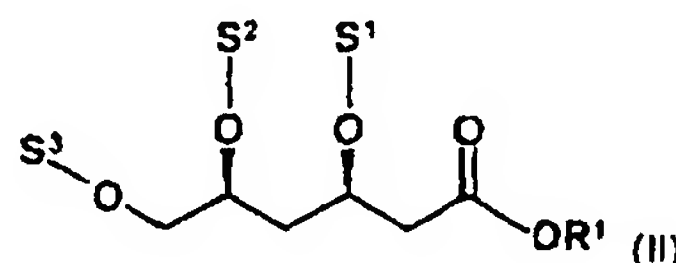
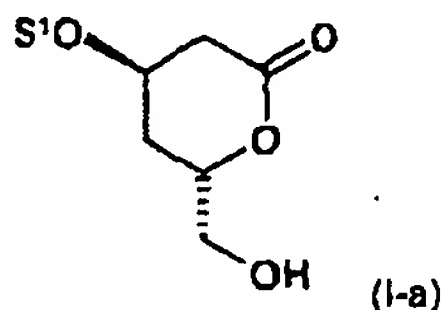
(74) Anwälte: BEST, Michael usw.; Lederer & Keller, Prinzre-
gentenstr. 16, 80538 München (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für
jede verfügbare nationale Schutzrechtsart): AE, AG, AL,
AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH,
CN, CO, CR, CU, CZ, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,
GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,
KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHOD FOR THE PRODUCTION OF STATINS

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON STATINEN



(57) Abstract: The invention relates to a method for the production of a statin. Said method comprises the following steps: a) a compound of formula (II) is produced, wherein S¹ represents a hydrogen atom or a hydroxyl protective group, S² and S³ independently represent a hydroxyl protective group and R¹ represents a hydrogen atom or a carboxyl protective group. Said compound of formula (II) is produced by stereoselective hydrogenation of a compound of formula (III) in order to form a compound of formula (II-a) and, optionally, by introducing a hydroxyl protective group. b) by lactonising the compound of formula (II) in order to form a compound of formula (I-a).

(57) Zusammenfassung: Erfindungsgemäß wird ein Verfahren zur Herstellung eines Statins zur Verfügung gestellt, umfassend die folgenden Schritte: a) Herstellung einer Verbindung der Formel (II), in der S¹ ein Wasserstoffatom oder eine Hydroxylschutzgruppe bedeutet, S² und S³ unabhängig voneinander Hydroxylschutzgruppen bedeuten und R¹ ein Wasserstoffatom oder eine Carboxylschutzgruppe darstellt, durch stereoselektive Hydrierung einer Verbindung der Formel (III) zu einer Verbindung der Formel (II-a) und gegebenenfalls Einführung einer Hydroxylschutzgruppe und b) Lactonisierung der Verbindung der Formel (II) zu einer Verbindung der Formel (I-a).

BEST AVAILABLE COPY



MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BE, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

— mit internationalem Recherchenbericht

(84) Bestimmungsstaaten (soweit nicht anders angegeben, für jede verfügbare regionale Schutzrechtsart): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SI, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LU, MC, NL, PL,

(88) Veröffentlichungsdatum des internationalen

Recherchenberichts:

6. Oktober 2005

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.